(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.[5]
C07J 79/00

(11) 공개번호 특1990-0016253
(43) 공개일자 1990년11월13일

(21) 출원번호 특1989-0005863
(22) 출원일자 1989년04월29일

(30) 우선권주장 P3814694.0 1988년04월30일 스위스(CH)

(71) 출원인 산도즈 리미티드 진 크라메르. 한스 루돌프 하우스
스위스연방, 체하-4002 바슬, 리히트 스트라세 35

(72) 발명자 모이제 아즈리아
스위스연방, 체하-4054 바슬, 분데스플라쯔 6
즈데 네크 브리크
스위스연방, 체하-4466 오르말링겐, 매테베그 11베

(74) 대리인 나영환, 윤동열

심사청구 : 없음

(54) 아미드화 타우린 또는 글리신의 산부가염, 그의 제조방법과 용도

요약

내용 없음.

대표도

도1

명세서

[발명의 명칭]

아미드화 타우린 또는 글리신의 산부가염, 그의 제조방법과 용도

[도면의 간단한 설명]

제1도는 실시예 a, b 및 c의 혼합물을 적용한 경우, 혈장당 살몬 칼시토닌의 밀리-국제단위대 적용시간을 도시한 것이다.

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

아미노기가 3α, 7α, 12α-트리히드록시 스테로이드 카르복실산의 아실기에 의해 치환된 타우린 또는 글리신을, (a) 카르복실기 이외의 치환체를 지닌 지방족 아민이나 (b) 알파 아미노산기 및 또다른 아미노기 사이에 알킬렌 다리를 지닌 염기성 알파아미노산과 결합하는 것으로 구성되는 산부가 염의 제조방법.

청구항 2

아미노기가 3α, 7α, 12α-트리히드록시 스테로이드 카르복실산의 아실기에 의해 치환된 타루린 또는 글리신의 음이온과, (a) 카르복실기 이외의 치환체를 지닌 지방족 아민 또는 (b) 염기성 알파 아미노산의 양이온과의 산부가염을 처리하는 것으로 구성되는 약학적 조성물의 제조방법.

청구항 3

본 실시예들 중 어느 하나에 기술된 바의 염을 제조하는 방법.

청구항 4

본 실시예들 중 어느 하나에 기술된 바의 약학적 조성물의 제조방법.

청구항 5

ⅰ) 아미노기가 3α, 7α, 12α-트리히드록시 스테로이드 카르복실산의 아실기에 의해 치환된 타우린 또는 글리신의 음이온과, ⅱ)(a) 카르복실기 이외의 치환체를 지닌 지방족아민, 또는 (b) 알카 아미노산기와 기타 아미노기 사이에 알킬렌 다리를 지닌 염기성 알파 아미노산의 양이온과의 산 부가염.

청구항 6

제5항에 있어서, 상기 음이온이 타우로콜릭산 또는 글리코콜릭산으로부터 유도되는 산부가염.

청구항 7

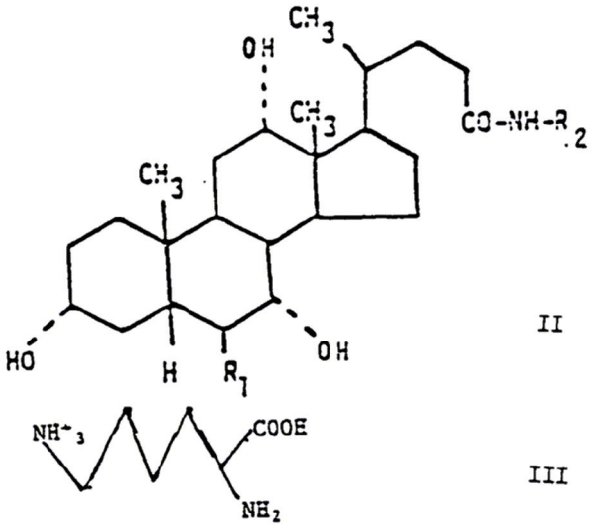
제5항 또는 제6항에 있어서, 상기 음이온이 알파 아미노산기와 또다른 아미노기 사이에 알킬렌 다리를 지닌 염기성 알파 아미노산으로부터 유도되는 산부가염.

청구항 8

제6항에 있어서, 상기 양이온이 리신으로부터 유도되는 산부가염.

청구항 9

하기식(Ⅱ)의 음이온과 하기식(Ⅲ)의 양이온과의 산부 가염.



상기 식에서, R_1= 또는 H, OH, R_2=$-CH_1COO^-$ 또는 $-CH_2-CH_2-SO_3$.

청구항 10

제9항에 있어서, 타우로콜릭산 또는 글리코콜릭산과 리신과의 염인 산 부가염.

청구항 11

타우로콜릭산 리시네이트.

청구항 12

제1항 또는 제3항의 방법에 의해 산출된 염.

청구항 13

적어도 하나의 약물학적 활성제와, 아미노기가 3α, 7α, 12α-트리히드록시 스테로이드 카르복실산의 아실기에 의해 치환된 타우린 또는 글리신의 음이온과, (a) 카르복실기 이외의 치환체를 지닌 지방족 아민의 양이온 또는, (b) 염기성 알파 아미노산의 양이온과의 산 부가염을 함유한 약학적 조성물.

청구항 14

제13항에 있어서, 상기 염은 제5항 내지 제12항 중 어느 하나에 정의된 바의 염인 역학적 조성물.

청구항 15

제12항 또는 제14항에 있어서, 약물학적 활성제는 칼시토닌인 약학적 조성물.

청구항 16

제12항 또는 제14항에 있어서, 약물학적 활성제는 옥트레오티드인 약학적 조성물.

청구항 17

제12항 내지 제16항 중 어느 한 항에 있어서, 염 대 약물학적 활성제의 비는 1 : 1 내지 5000 : 1인 약

학적 조성물.

청구항 18

제13항 내지 제17항 중 어느 한 항에 있어서, 약 0.1 내지 100mg의 염을 각각 함유한 단위 용량형으로 투여되는 약학적 조성물.

청구항 19

제13항 내지 제18항 중 어느 한 항에 있어서, 비강 투여용의 약학적 조성물.

청구항 20

제19항에 있어서, 염화나트륨을 함유한 수용액 형태인 약학적 조성물.

청구항 21

제13항 내지 제18항 중 어느 한 항에 있어서, 경구 투여용의 약학적 조성물.

청구항 22

제13항 내지 제21항 중 어느 한 항에 있어서, 제2항 또는 제4항의 방법에 따라 제조되는 약학적 조성물.

청구항 23

적어도 하나의 활성제를 함유한 약학적 조성물에서 부형제로서의 제13항에서 정의된 바의 혹은 제5항 내지 제12항 중의 어느 한 항에서 청구된 바의 산 부가염.

청구항 24

제23항에 있어서, 펩티드 또는 단백질 약제 화합물을 함유한, 약학적 조성물에서 부형제로서의 산 부가염.

청구항 25

제24항에 있어서, 수용성 펩티드 약제 화합물을 함유한, 약학적 조성물에서 부형제로서의 산 부가염.

청구항 26

제24항 또는 제25항에 있어서, 펩티드 약제 화합물로서 살몬 칼시토닌을 함유한, 약학적 조성물에서 부형제로서의 산 부가염.

청구항 27

제23항 내지 제26항 중 어느 한 항에 있어서, 단위 투여형당 2μg 내지 20mg의 펩티드 약제 화합물을 함유한, 약학조성물에서의 부형제로서의 산 부가염.

청구항 28

제23항 내지 제27항 중 어느 한 항에 있어서, 약학적 조성물에 부형제로서, 0.1 내지 10중량%로 함유된 산 부가염.

청구항 29

제23항 내지 제28항 중 어느 한 항에 있어서, 펩티드 약제 화합물의 점막 수송에 적합한 약학적 조성물에서 부형제로서의 산 부가염.

청구항 30

제23항 내지 제29항 중 어느 한 항에 있어서, 비강으로 투여되는, 약학적 조성물에서 부형제로서의 산 부가염.

청구항 31

제23항 내지 제30항 중 어느 한 항에 있어서, 분말 또는 액체형의 약학적 조성물에서 부형제로서의 산 부가염.

청구항 32

제23항 내지 제31항 중 어느 한 항에 있어서, 애토마이저의 약학적 조성물에서 부형제로서의 산 부가염.

청구항 33

제13항 내지 제22항 중 어느 한 항에 의해 산출된 약학적 조성물의 유효량을 투여하는 것으로 구성되는 환자에게 활성제를 투여하는 방법.

청구항 34

약학적 조성물의 제조에 제5항 내지 제12항 중 어느 한 항에 따른 염을 사용하는 방법.

※참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.

도면

도면1

